



DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITE DE COOPERATION EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

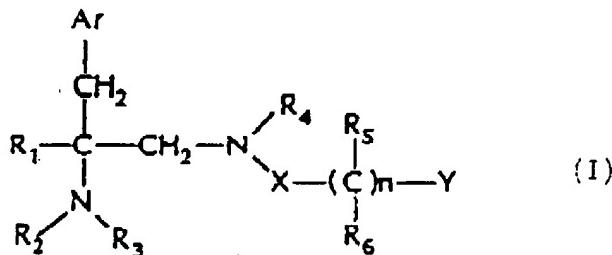
| | | |
|---|------|---|
| (51) Classification internationale des brevets ⁵ : C07C 233/40, A61K 31/16 C07C 233/37, 233/36, 211/27 A61K 31/135, C07D 295/125 A61K 31/535, C07D 207/325 A61K 31/40 | A.I. | (11) Numéro de publication internationale: WO 93/2227 (43) Date de publication internationale: 11 novembre 1993 (11.11.93) |
| (21) Numéro de la demande internationale: PCT/CH93/00106 (22) Date de dépôt international: 22 avril 1993 (22.04.93) | | (74) Mandataires: DOUSSE, Blasco etc. ; 7, route de Drize, CH-1227 Carouge (CH). |
| (30) Données relatives à la priorité: 1365/92-0 28 avril 1992 (28.04.92) CH | | (81) Etats désignés: AU, CA, JP, US, brevet européen (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE). |
| (71) Déposant (<i>pour tous les Etats désignés sauf US</i>): BATTELLE MEMORIAL INSTITUTE [US/CH]; 7, route de Drize, CH-1227 Carouge (CH). | | Publiée <i>Avec rapport de recherche internationale.</i> |
| (72) Inventeur; et (75) Inventeur/Déposant (<i>US seulement</i>): ROCHE, Jean-Philippe [FR/FR]; 21, rue Maryse-Bastié, F-74240 Gaillard (FR). | | |

(54) Title: DIAMINE DERIVATIVES HAVING SELECTIVE AFFINITY FOR SIGMA RECEPTORS

(54) Titre: DERIVES DIAMINES AYANT UNE AFFINITE SELECTIVE POUR LES RÉCEPTEURS SIGMA

(57) Abstract

Diamine derivatives of formula (I), wherein n = 0-8; R₁ is hydrogen or a C₁₋₃ alkyl residue; each of R₂, R₃, R₄, R₅ and R₆ is hydrogen, a C₁₋₆ alkyl residue, branched C₄₋₁₂ alkyl or alkenyl; R₂ and R₃ together may form a C₃₋₈ ring optionally including a heteroatom and optionally partially or wholly unsaturated; R₅ and R₆ taken together may form a C₂₋₈ ring; X is a single bond, -CH₂-, -C(=O)-, -S(O)-, or -S(O)₂-; Y is an alkyl residue, cycloalkyl, cycloalkylalkyl, adamantyl, optionally substituted phenyl or an aromatic heterocyclic ring; Ar is an optionally substituted phenyl radical, naphtyl or an aromatic heterocyclic ring. Said derivatives are psychotropic agents particularly suitable for treating psychotic disorders, convulsion, dyskinesia, brain distress (ischaemia, hypoxia) and anxiety, and further have anti-inflammatory properties.



(57) Abrégé

L'invention concerne des dérivés diaminés de formule (I) dans laquelle: n = 0 à 8; R₁ représente un hydrogène ou un reste alkyle de C₁ à C₃; R₂, R₃, R₄, R₅ et R₆ représentent indépendamment un hydrogène, un reste alkyle (1 à 6 C), alkyle ramifié (4-12 C), alkényle; R₂ et R₃ pris ensemble peuvent former un cycle (3 à 8 C) pouvant inclure un hétéroatome et pouvant être partiellement ou totalement insaturé; R₅ et R₆ pris ensemble peuvent former un cycle (2 à 8 C); X représente une liaison simple, -CH₂-, -C(=O)-, -S(O)-, -S(O)₂-; Y est un reste alkyle, cycloalkyle, cycloalkylalkyle, adamantyl, phényle substitué ou non ou un hétérocycle aromatique; Ar est un radical phényle substitué ou non, naphtyl ou un hétérocycle aromatique; ces dérivés sont des psychotropes plus particulièrement indiqués dans les troubles psychotiques, les convulsions, les dyskinésies, les souffrances cérébrales (ischémie, hypoxie) et l'anxiété. Ils possèdent également des propriétés anti-inflammatoires.

| | | | | | |
|--|--|--|--|----------------------------------|--------------------------|
| FORM PTO-1449 (REV. 2-82) | | U.S. DEPARTMENT OF COMMERCE PATENT AND TRADEMARK OFFICE | | Atty. Docket No. 1103326-0590 | Serial No. 09/381,055 |
| INFORMATION DISCLOSURE STATEMENT BY APPLICANT | | Applicant: Asghar et al. | | | |
| | | Filing Date: September 13, 1999 | | Group: To be assigned | |
| | | | | | |

UNITED STATES PATENT DOCUMENTS

| *Examiner Initial | Document No. | | | | | | | Date | Name | Class | Sub-Class | Filing Date, if Appropriate |
|-------------------|--------------|---|---|---|---|---|---|---------|------------------|-------|-----------|-----------------------------|
| | 5 | 5 | 3 | 8 | 9 | 9 | 3 | 7/23/96 | Mechoulam et al. | | | |
| | 5 | 6 | 3 | 5 | 5 | 3 | 0 | 6/3/97 | Mechoulam et al | | | |

FOREIGN PATENT DOCUMENTS

| *Examiner Initial | Document No. | | | | | | | Date | Country | Class | Sub-Class | Translation Yes No |
|-------------------|--------------|---|---|---|---|---|---|----------|---------|-------|-----------|--------------------|
| | 0 | 6 | 1 | 5 | 7 | 4 | 9 | 9/21/94 | EP | | | |
| | 0 | 2 | 7 | 9 | 9 | 3 | 7 | 8/31/88 | EP | | | |
| | 9 | 3 | 2 | 2 | 2 | 7 | 9 | 11/11/93 | WO | | | |
| | 9 | 7 | 0 | 9 | 3 | 1 | 7 | 3/13/97 | WO | | | |
| | 9 | 7 | 1 | 4 | 4 | 1 | 5 | 4/24/97 | WO | | | |

OTHER DOCUMENTS (including Author, Title, Date, Pertinent Pages, Etc.)

| | |
|---|---|
| A | de la Torre et al, Current Therapeutic Research 38, 661-669 (1985). |
| B | Neugebauer et al, NeuroReport 4, 1259-1262 (1993). |
| | |
| | |

Examiner:

Date Considered:

*Examiner: Initial citation considered, whether or not citation is in conformance with MPEP 609; Draw line through citation if not in conformance and not considered. Include copy of this form with next communication to applicant.